



## SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus  
Patent- och registerstyrelsen

|  |                         |
|--|-------------------------|
| (11) (21) Patentihakemus - Patentansökan             | 965019                  |
| (51) Kv.lk.6 - Int.kl.6                              |                         |
| C 07C 317/48, 317/50, 317/02<br>327/58, A 61K 31/195 |                         |
| (22) Hakemispäivä - Ansökningsdag                    | 13.12.1996              |
| (24) Alkuperäpäivä - Löpdag                          | 14.06.1995              |
| (41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig            | 13.12.1996              |
| (86) Kv. hakemus - Int. ansökan                      | PCT/GB95/01378          |
| (32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet                 |                         |
| 15.06.1994 EP 94304314 P                             | 15.05.1995 GB 9509774 P |

(71) Hakija - Sökande

1. The Wellcome Foundation Limited, c/o Glaxo Wellcome House, Berkeley avenue, Greenford, Middlesex UB6 ONN, United Kingdom, (GB)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Hodson, Harold Francis, Langley Court, Beckenham, Kent BR3 3BS, United Kingdom, (GB)
2. Palmer, Richard Michael John, Langley Court, Beckenham, Kent BR3 3BS, United Kingdom, (GB)
3. Sawyer, David Alan, Langley Court, Beckenham, Kent BR3 3BS, United Kingdom, (GB)
4. Knowles, Richard Graham, Langley Court, Beckenham, Kent BR3 3BS, United Kingdom, (GB)
5. Franzmann, Karl Witold, Langley Court, Beckenham, Kent BR3 3BS, United Kingdom, (GB)
6. Drysdale, Martin James, Langley Court, Beckenham, Kent BR3 3BS, United Kingdom, (GB)
7. Smith, Steven, Langley Court, Beckenham, Kent BR3 3BS, United Kingdom, (GB)
8. Davies, Patricia Ifeyinwa, Langley Court, Beckenham, Kent BR3 3BS, United Kingdom, (GB)
9. Clark, Helen Alice Rebecca, Langley Court, Beckenham, Kent BR3 3BS, United Kingdom, (GB)
10. Shearer, Barry George, 203 Wintermist Drive, Cary, NC 27513, USA, (US)

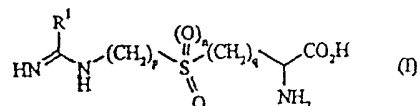
(74) Asiamies - Ombud: Kolster Oy Ab, Iso Roobertinkatu 23, 00120 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Entsyymi-inhibiittoreita  
Enzym-inhibitorer

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee yhdistettä, jolla on kaava (I),



jossa R<sup>1</sup> on suoraketjuinen tai haarautunut C<sub>1-6</sub>-alkyyli-ryhmä, C<sub>2-6</sub>-alkenyyliryhmä, C<sub>2-6</sub>-alkynyyliryhmä, C<sub>3-6</sub>-sykloalkyyli-ryhmä tai C<sub>3-6</sub>-sykloalkyyli-C<sub>1-6</sub>-alkyyli-ryhmä, joista kukin voi haluttaessa olla substituoitu 1 - 3 ryhmällä, joista kukin on itsenäisesti ryhmä -CN; ryhmä -NO<sub>2</sub>; ryhmä -COR<sup>2</sup>, jossa R<sup>2</sup> on vety, C<sub>1-6</sub>-alkyyli-ryhmä, ryhmä -OR<sup>3</sup>, jossa R<sup>3</sup> on vety tai C<sub>1-6</sub>-alkyyli-ryhmä, tai ryhmä -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, jossa kumpikin ryhmistä R<sup>4</sup> ja R<sup>5</sup> on itsenäisesti vety tai C<sub>1-6</sub>-alkyyli-ryhmä; ryhmä -S(O)<sub>m</sub>R<sup>6</sup>, jossa m on 0, 1 tai 2 ja R<sup>6</sup> on vety, C<sub>1-6</sub>-alkyyli-ryhmä, hydroksyyli-ryhmä tai ryhmä -NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, jossa kumpikin ryhmistä R<sup>7</sup> ja R<sup>8</sup> on itsenäisesti vety tai C<sub>1-6</sub>-alkyyli-ryhmä; ryhmä -PO(OR<sup>9</sup>)<sub>2</sub>, jossa R<sup>9</sup> on vety tai C<sub>1-6</sub>-alkyyli-ryhmä; ryhmä -NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, jossa kumpikin ryhmistä R<sup>10</sup> ja R<sup>11</sup> on itsenäisesti

vety, C<sub>1-6</sub>-alkyyli-ryhmä, ryhmä -COR<sup>12</sup>, jossa R<sup>12</sup> on vety tai C<sub>1-6</sub>-alkyyli-ryhmä, tai ryhmä -S(O)<sub>m</sub>R<sup>13</sup>, jossa m' on 0, 1 tai 2 ja R<sup>13</sup> on vety tai C<sub>1-6</sub>-alkyyli-ryhmä; halogeeni tai ryhmä -OR<sup>14</sup>, jossa R<sup>14</sup> on vety, C<sub>1-6</sub>-alkyyli-ryhmä, joka on mahdollisesti substituoitu 1 - 3 halogeeniatomilla, C<sub>6-10</sub>-aryyli-ryhmä tai ryhmä -COR<sup>15</sup>, jossa R<sup>15</sup> on vety tai C<sub>1-6</sub>-alkyyli-ryhmä; p on 2 tai 3, q on 1 tai 2 ja n on 0 tai 1; sekä kaikkia sen suoloja, estereitä, amideja ja fysiologisesti hyväksyttäviä lääke-estereitä, niiden farmaseuttisia käyttöjä ja niitä sisältäviä farmaseuttisia koostumuksia sekä menetelmiä niiden valmistamiseksi.

Jatkuu seur. sivulla  
Forts. nästa sida

Uppfinningen avser en förening med formeln (I), vari R<sup>1</sup> är en rak eller förgrenad C<sub>1-6</sub>-alkylgrupp, C<sub>2-6</sub>-alkenylgrupp, C<sub>2-6</sub>-alkynylgrupp, C<sub>3-6</sub>-cykloalkylgrupp eller C<sub>3-6</sub>-cykloalkyl-C<sub>1-6</sub>-alkylgrupp, var och en valfritt substituerad med en till tre grupper valda oberoende av varandra från gruppen -CN; gruppen -NO<sub>2</sub>; gruppen -COR<sup>2</sup>, vari R<sup>2</sup> väte, en C<sub>1-6</sub>-alkylgrupp, gruppen -OR<sup>3</sup>, vari R<sup>3</sup> är väte eller en C<sub>1-6</sub>-alkylgrupp, eller gruppen -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, vari grupperna R<sup>4</sup> och R<sup>5</sup> är oberoende av varandra väte eller en C<sub>1-6</sub>-alkylgrupp; gruppen -S(O)<sub>m</sub>R<sup>6</sup>, vari m är 0, 1 eller 2 och R<sup>6</sup> är väte, en C<sub>1-6</sub>-alkylgrupp, en hydroxylgrupp eller gruppen -NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, vari grupperna R<sup>7</sup> och R<sup>8</sup> är oberoende av varandra väte eller en C<sub>1-6</sub>-alkylgrupp; gruppen -PO(OR<sup>9</sup>)<sub>2</sub>, vari R<sup>9</sup> är väte eller en C<sub>1-6</sub>-alkylgrupp; gruppen -NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, vari grupperna R<sup>10</sup> och R<sup>11</sup> är oberoende av varandra väte, en C<sub>1-6</sub>-alkylgrupp, gruppen -COR<sup>12</sup>, vari R<sup>12</sup> är väte eller en C<sub>1-6</sub>-alkylgrupp, eller gruppen -S(O)<sub>m'</sub>R<sup>13</sup>, vari m' är 0, 1 eller 2 och R<sup>13</sup> är väte eller en C<sub>1-6</sub>-alkylgrupp; halogen eller gruppen -OR<sup>14</sup>, vari R<sup>14</sup> är väte, en C<sub>1-6</sub>-alkylgrupp, som är valfritt substituerad med från en till tre halogenatomer, en C<sub>6-10</sub>-arylgrupp eller gruppen -COR<sup>15</sup>, vari R<sup>15</sup> är väte eller en C<sub>1-6</sub>-alkylgrupp; p är 2 eller 3, q är 1 eller 2 och n är 0 eller 1; samt alla salter, estrar, amider och fysiologiskt acceptabla prodrug-former av den, farmaceutisk användning av dem och farmaceutiska kompositioner, som innehåller dem, samt förfaranden för framställning av dem.

